

## 特許協力条約

PCT

REC'D 16 DEC 2004

WIPO

PCT

特許性に関する国際予備報告（特許協力条約第二章）

(法第12条、法施行規則第56条)  
[PCT 36条及びPCT規則70]

出願人又は代理人 の書類記号 KW0131	今後の手続きについては、様式PCT/IPEA/416を参照すること。	
国際出願番号 PCT/JPO3/15154	国際出願日 (日.月.年) 27. 11. 2003	優先日 (日.月.年) 28. 11. 2002
国際特許分類 (IPC) Int. Cl' C07D 235/28, C07D 295/18		
出願人 (氏名又は名称) 興和株式会社		

1. この報告書は、PCT 35条に基づきこの国際予備審査機関で作成された国際予備審査報告である。  
法施行規則第57条 (PCT 36条) の規定に従い送付する。

2. この国際予備審査報告は、この表紙を含めて全部で 4 ページからなる。

3. この報告には次の附属物件も添付されている。

a  附属書類は全部で        ページである。

指定されて、この報告の基礎とされた及び／又はこの国際予備審査機関が認めた訂正を含む明細書、請求の範囲及び／又は図面の用紙 (PCT規則70.16及び実施細則第607号参照)

第I欄4. 及び補充欄に示したように、出願時における国際出願の開示の範囲を超えた補正を含むものとこの国際予備審査機関が認定した差替え用紙

b  電子媒体は全部で        (電子媒体の種類、数を示す)。  
配列表に関する補充欄に示すように、コンピュータ読み取り可能な形式による配列表又は配列表に関連するデータを含む。 (実施細則第802号参照)

4. この国際予備審査報告は、次の内容を含む。

第I欄 国際予備審査報告の基礎  
 第II欄 優先権  
 第III欄 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての国際予備審査報告の不作成  
 第IV欄 発明の単一性の欠如  
 第V欄 PCT 35条(2)に規定する新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての見解、それを裏付けるための文献及び説明  
 第VI欄 ある種の引用文献  
 第VII欄 国際出願の不備  
 第VIII欄 国際出願に対する意見

国際予備審査の請求書を受理した日 14. 04. 2004	国際予備審査報告を作成した日 29. 11. 2004
名称及びあて先 日本国特許庁 (IPEA/JP) 郵便番号100-8915 東京都千代田区霞が関三丁目4番3号	特許庁審査官 (権限のある職員) 小堀 麻子
	4C 3336
	電話番号 03-3581-1101 内線 3452

## 第I欄 報告の基礎

1. この国際予備審査報告は、下記に示す場合を除くほか、国際出願の言語を基礎とした。

この報告は、\_\_\_\_\_語による翻訳文を基礎とした。  
それは、次の目的で提出された翻訳文の言語である。

PCT規則12.3及び23.1(b)にいう国際調査  
 PCT規則12.4にいう国際公開  
 PCT規則55.2又は55.3にいう国際予備審査

2. この報告は下記の出願書類を基礎とした。(法第6条(PCT14条)の規定に基づく命令に応答するために提出された差替え用紙は、この報告において「出願時」とし、この報告に添付していない。)

出願時の国際出願書類

明細書

第 _____	ページ、	出願時に提出されたもの
第 _____	ページ*、	付けで国際予備審査機関が受理したもの
第 _____	ページ*、	付けで国際予備審査機関が受理したもの

請求の範囲

第 _____	項、	出願時に提出されたもの
第 _____	項*、	PCT19条の規定に基づき補正されたもの
第 _____	項*、	付けで国際予備審査機関が受理したもの
第 _____	項*、	付けで国際予備審査機関が受理したもの

図面

第 _____	ページ/図、	出願時に提出されたもの
第 _____	ページ/図*、	付けで国際予備審査機関が受理したもの
第 _____	ページ/図*、	付けで国際予備審査機関が受理したもの

配列表又は関連するテーブル

配列表に関する補充欄を参照すること。

3.  補正により、下記の書類が削除された。

<input type="checkbox"/> 明細書	第 _____	ページ
<input type="checkbox"/> 請求の範囲	第 _____	項
<input type="checkbox"/> 図面	第 _____	ページ/図
<input type="checkbox"/> 配列表 (具体的に記載すること)		
<input type="checkbox"/> 配列表に関連するテーブル (具体的に記載すること)		

4.  この報告は、補充欄に示したように、この報告に添付されかつ以下に示した補正が出願時における開示の範囲を超えてされたものと認められるので、その補正がされなかつたものとして作成した。(PCT規則70.2(c))

<input type="checkbox"/> 明細書	第 _____	ページ
<input type="checkbox"/> 請求の範囲	第 _____	項
<input type="checkbox"/> 図面	第 _____	ページ/図
<input type="checkbox"/> 配列表 (具体的に記載すること)		
<input type="checkbox"/> 配列表に関連するテーブル (具体的に記載すること)		

\* 4. に該当する場合、その用紙に "superseded" と記入されることがある。

第V欄 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての法第12条 (PCT35条(2)) に定める見解、それを裏付ける文献及び説明

## 1. 見解

新規性 (N)	請求の範囲 請求の範囲	1, 2	有 無
進歩性 (I S)	請求の範囲 請求の範囲	1, 2	有 無
産業上の利用可能性 (I A)	請求の範囲 請求の範囲	1, 2	有 無

## 2. 文献及び説明 (PCT規則70.7)

文献1: WO 98/54153 A1 (KOWA COMPANY LTD) 1998.12.03  
 文献2: EP 334818 A1 (DOMPE FARMACEUTICI SPA) 1989.09.27  
 文献3: US 3585194 A (ROHM AND HAAS CO) 1971.06.15  
 文献4: DE 2209853 A1 (E. R. SQUIBB AND SONS INC) 1972.09.07  
 文献5: US 5068264 A (BAYER AKTIENGESELLSCHAFT) 1991.11.26

文献1には、1-(2-ヒドロキシエチル)ピペラジンを出発物質とし、その二級アミンを保護基、好ましくはBoc基で保護する過程を含む、1-[2-(ベンズイミダゾール-2-イルチオ)エチル]ピペラジンの製造方法が記載されている (第21-23頁)。

文献2には、2-メルカプト-1H-ベンゾイミダゾールと1-(2-クロロエチル)-4-メチルピペラジン塩酸塩とを反応させて2-[2-(4-メチルピペラジン-1-イル)エチルチオ]ベンゾイミダゾールを得た過程が記載されている (Example 1)。

文献3、4、5には、それぞれN-ヒドロキシエチル-N'-ホルミルピペラジンが記載されている (文献3 PREPARATION F、文献4 Beispiel 20、文献5 Example 1)。

しかしながら、本願請求の範囲1、2に係る発明における、1-ホルミル-4-(2-ヒドロキシエチル)ピペラジンを出発物質とする1-[2-(ベンズイミダゾール-2-イルチオ)エチル]ピペラジンの製造方法は、国際調査報告で引用された上記文献のいずれにも記載されておらず、また、当業者といえども自明のものではない。

## 第VI欄 ある種の引用文献

## 1. ある種の公表された文書 (PCT規則70.10)

出願番号 特許番号	公知日 (日.月.年)	出願日 (日.月.年)	優先日 (有効な優先権の主張) (日.月.年)
WO 03/057675 A1 [E, X]	17.07.2003	27.12.2002	28.12.2001

## 2. 書面による開示以外の開示 (PCT規則70.9)

書面による開示以外の開示の種類	書面による開示以外の開示の日付 (日.月.年)	書面による開示以外の開示に言及している 書面の日付 (日.月.年)

Translation

ATENT COOPERATION TREATY

PCT/JP2003/015154

PCT

INTERNATIONAL PRELIMINARY REPORT ON PATENTABILITY  
(Chapter II of the Patent Cooperation Treaty)

(PCT Article 36 and Rule 70)

Applicant's or agent's file reference <b>KW0131</b>	<b>FOR FURTHER ACTION</b>	See Form PCT/IPEA/416
International application No. <b>PCT/JP2003/015154</b>	International filing date ( <i>day/month/year</i> ) <b>27 November 2003 (27.11.2003)</b>	Priority date ( <i>day/month/year</i> ) <b>28 November 2002 (28.11.2002)</b>
International Patent Classification (IPC) or national classification and IPC <b>C07D 235/28, 295/18</b>		
Applicant <b>KOWA CO., LTD.</b>		

1. This report is the international preliminary examination report, established by this International Preliminary Examining Authority under Article 35 and transmitted to the applicant according to Article 36.

2. This REPORT consists of a total of 5 sheets, including this cover sheet.

3. This report is also accompanied by ANNEXES, comprising:

a.  (*sent to the applicant and to the International Bureau*) a total of \_\_\_\_\_ sheets, as follows:

sheets of the description, claims and/or drawings which have been amended and are the basis of this report and/or sheets containing rectifications authorized by this Authority (see Rule 70.16 and Section 607 of the Administrative Instructions).

sheets which supersede earlier sheets, but which this Authority considers contain an amendment that goes beyond the disclosure in the international application as filed, as indicated in item 4 of Box No. I and the Supplemental Box.

b.  (*sent to the International Bureau only*) a total of (indicate type and number of electronic carrier(s)) \_\_\_\_\_, containing a sequence listing and/or tables related thereto, in computer readable form only, as indicated in the Supplemental Box Relating to Sequence Listing (see Section 802 of the Administrative Instructions).

4. This report contains indications relating to the following items:

Box No. I Basis of the report  
 Box No. II Priority  
 Box No. III Non-establishment of opinion with regard to novelty, inventive step and industrial applicability  
 Box No. IV Lack of unity of invention  
 Box No. V Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement  
 Box No. VI Certain documents cited  
 Box No. VII Certain defects in the international application  
 Box No. VIII Certain observations on the international application

Date of submission of the demand <b>14 April 2004 (14.04.2004)</b>	Date of completion of this report <b>29 November 2004 (29.11.2004)</b>
Name and mailing address of the IPEA/JP	Authorized officer
Facsimile No.	Telephone No.

## INTERNATIONAL PRELIMINARY REPORT ON PATENTABILITY

International application No.

PCT/JP2003/015154

## Box No. I Basis of the report

1. With regard to the language, this report is based on the international application in the language in which it was filed, unless otherwise indicated under this item.

This report is based on translations from the original language into the following language \_\_\_\_\_, which is language of a translation furnished for the purpose of:

international search (under Rules 12.3 and 23.1(b))  
 publication of the international application (under Rule 12.4)  
 international preliminary examination (under Rules 55.2 and/or 55.3)

2. With regard to the elements of the international application, this report is based on (replacement sheets which have been furnished to the receiving Office in response to an invitation under Article 14 are referred to in this report as "originally filed" and are not annexed to this report):

The international application as originally filed/furnished

the description:

pages \_\_\_\_\_, as originally filed/furnished

pages\* \_\_\_\_\_ received by this Authority on \_\_\_\_\_

pages\* \_\_\_\_\_ received by this Authority on \_\_\_\_\_

the claims:

pages \_\_\_\_\_, as originally filed/furnished

pages\* \_\_\_\_\_, as amended (together with any statement) under Article 19

pages\* \_\_\_\_\_ received by this Authority on \_\_\_\_\_

pages\* \_\_\_\_\_ received by this Authority on \_\_\_\_\_

the drawings:

pages \_\_\_\_\_, as originally filed/furnished

pages\* \_\_\_\_\_ received by this Authority on \_\_\_\_\_

pages\* \_\_\_\_\_ received by this Authority on \_\_\_\_\_

a sequence listing and/or any related table(s) – see Supplemental Box Relating to Sequence Listing.

3.  The amendments have resulted in the cancellation of:

the description, pages \_\_\_\_\_  
 the claims, Nos. \_\_\_\_\_  
 the drawings, sheets/figs \_\_\_\_\_  
 the sequence listing (specify): \_\_\_\_\_  
 any table(s) related to sequence listing (specify): \_\_\_\_\_

4.  This report has been established as if (some of) the amendments annexed to this report and listed below had not been made, since they have been considered to go beyond the disclosure as filed, as indicated in the Supplemental Box (Rule 70.2(c)).

the description, pages \_\_\_\_\_  
 the claims, Nos. \_\_\_\_\_  
 the drawings, sheets/figs \_\_\_\_\_  
 the sequence listing (specify): \_\_\_\_\_  
 any table(s) related to sequence listing (specify): \_\_\_\_\_

\* If item 4 applies, some or all of those sheets may be marked "superseded."

## INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

International application No.  
PCT/JP 03/15154

## V. Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement

## 1. Statement

Novelty (N)	Claims	1, 2	YES
	Claims		NO
Inventive step (IS)	Claims	1, 2	YES
	Claims		NO
Industrial applicability (IA)	Claims	1, 2	YES
	Claims		NO

## 2. Citations and explanations

Document 1: WO 98/54153 A1 (Kowa Co., Ltd.), 03 December 1998

Document 2: EP 334818 A1 (Dompe Farmaceutici SPA), 27 September 1989

Document 3: US 3585194 A (Rohm And Haas Co.), 15 June 1971

Document 4: DE 2209853 A1 (E. R. Squibb And Sons, Inc.), 07 September 1972

Document 5: US 5068264 A (Bayer AG.), 26 November 1991

Document 1 discloses a method for the production of 1-[2-(benzimidazole-2-ylthio) ethyl] piperazine which employs 1-(2-hydroxyethyl) piperazine as a starting material, wherein said method includes a step in which the secondary amine of the starting material is protected by means of a protective group, preferably by means of a Boc group (refer to pages 21 to 23).

Document 2 discloses a process in which 2-mercaptop-1H-benzimidazole and 1-(2-chloroethyl)-4-methylpiperazine hydrochloride are reacted in order to obtain a 2-{2-(4-methylpiperazine-1-yl) ethylthio} benzimidazole (refer to example 1).

Documents 3, 4 and 5 disclose N-hydroxyethyl-N'-formylpiperazine (refer to document 3, preparation F;

**INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT**

International application No.

PCT/JP 03/15154

document 4, Beispiel 20; and document 5, example 1).

However, the method for the production of 1-[2-(benzimidazole-2-ylthio) ethyl] piperazine wherein 1-formyl-4-(2-hydroxyethyl) piperazine is used as a starting material in the invention that is set forth in claims 1 and 2 of the present application is not disclosed in any of the documents that are cited in the international search report, and is not obvious to a person skilled in the art.

## INTERNATIONAL PRELIMINARY REPORT ON PATENTABILITY

International application No.

PCT/JP2003/015154

## Box No. VI Certain documents cited

## 1. Certain published documents (Rule 70.10)

Application No. Patent No.	Publication date (day/month/year)	Filing date (day/month/year)	Priority date (valid claim) (day/month/year)
WO 03/057675 A1	17 July 2003 (17.07.2003)	27 December 2002 (27.12.2002)	28 December 2001 (28.12.2001)

[E, X]

## 2. Non-written disclosures (Rule 70.9)

Kind of non-written disclosure	Date of non-written disclosure (day/month/year)	Date of written disclosure referring to non-written disclosure (day/month/year)